

P02/046

6x40p

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
16. Oktober 2003 (16.10.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer

WO 03/084533 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/402,
31/451, C07D 207/22, 211/72, 401/12, 453/06GLEITZ, Johannes [DE/DE]; Liebigstrasse 26, 64293
Darmstadt (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/02349

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH;
Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).(22) Internationales Anmeldedatum:
7. März 2003 (07.03.2003)(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

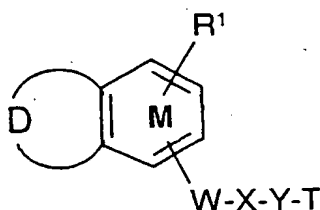
(30) Angaben zur Priorität:
102 14 832.5 4. April 2002 (04.04.2002) DE(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter
Strasse 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): CEZANNE, Bertram
[DE/DE]; Bahnstrasse 74, 64546 Mörfelden-Walldorf
(DE). DORSCH, Dieter [DE/DE]; Königsberger Strasse
17A, 64372 Ober-Ramstadt (DE). MEDERSKI, Werner
[DE/DE]; Katzenelnbogenweg 1, 64673 Zwingenberg
(DE). TSAKLAKIDIS, Christos [GR/DE]; Im Langge-
wann 54, 69469 Weinheim (DE). BARNES, Christopher
[GB/DE]; Alleestrasse 1, 65812 Bad Soden (DE).(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

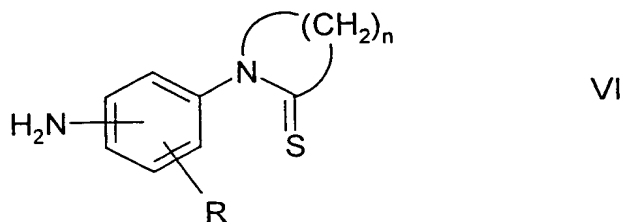
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.(54) Title: N-4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL-ACETAMIDE AND CORRESPONDING PIPERIDINE
DERIVATIVES AS FACTOR XA INHIBITORS FOR THE TREATMENT OF THROMBO-EMBOLIC DISEASES(54) Bezeichnung: N-4-(2-IMINO-PYRROLIDIN-1-YL)PHENYL-ACETEMID-UND ENTSPRECHENDE PIPERIDINDERI-
VATE ALS FAKTOR XA INHIBITOREN ZUR BEHANDLUNG VON THROMBOEMBOLISCHEN ERKRANKUNGEN(57) **Abstract:** The invention relates to novel compounds of formula (I)
wherein D, M, W, X, Y, T and R¹ have the designation cited in patent
claim 1. According to the invention, said compounds are inhibitors of the
coagulation factor Xa and can be used for the prophylaxis and/or treatment
of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.(57) **Zusammenfassung:** Neue Verbindungen der Formel (I), worin D, M, W,
X, Y, T und R¹ die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung haben, sind
Inhibitoren des Koagulationsfaktors Xa und können zur Prophylaxe und/oder
Therapie von thromboembolischen Erkrankungen und zur Behandlung von Tu-

moren eingesetzt werden.

WO 03/084533 A1

Abstract

Novel compounds of the formula I



in which

D, M, W, X, Y, T and R¹ are as defined in Patent Claim 1,

15 are inhibitors of coagulation factor Xa and can be employed for the prophylaxis and/or therapy of thromboembolic diseases and for the treatment of tumours.

20

25

30

35